

⑫ 公開特許公報 (A)

昭63-216817

⑤Int.Cl.⁴A 61 K 9/06
7/00
7/42
7/44
47/00

識別記号

3 3 6

庁内整理番号

C-6742-4C
7306-4C
6971-4C
6971-4C
F-6742-4C

⑩公開 昭和63年(1988)9月9日

審査請求 未請求 発明の数 1 (全4頁)

⑪発明の名称 ゲル状組成物

⑫特願 昭62-50354

⑬出願 昭62(1987)3月6日

⑭発明者 木村 順治 東京都北区滝野川1丁目47番14号

⑮発明者 木本 知明 千葉県松戸市日暮347-1

⑯出願人 テルモ株式会社 東京都渋谷区幡ヶ谷2丁目44番1号

⑰代理人 弁理士 高木 千嘉 外2名

明 細 著

1. 発明の名称 ゲル状組成物

2. 特許請求の範囲

- (1) 半固型油脂分10~90% (重量パーセント、以下同じ) と低分子環状シリコーン90~10%とゲル化剤1~10%とを含有してなるゲル状組成物。
- (2) 半固型油脂分が常温で固型である油脂分と常温で液体である油脂分との混合物である特許請求の範囲第1項記載のゲル状組成物。
- (3) 環状シリコーンがオクタメチルシクロテトラシロキサンもしくはデカメチルシクロベンタシロキサンまたはそれらの混合物である特許請求の範囲第1項記載のゲル状組成物。
- (4) ゲル化剤がデキストリン脂肪酸エステル、シヨ糖脂肪酸エステル、セルロース誘導体およびリン脂質の1種または2種以上よりなる特許請求の範囲第1項記載のゲル状組成物。
- (5) ゲル状組成物がゲル軟膏基剤である特許請求の範囲第1項記載のゲル状組成物。

3. 発明の詳細な説明

【産業上の利用分野】

本発明はゲル状組成物に関する。本発明のゲル状組成物は皮膚科用および化粧用の軟膏剤に使用される。

【従来の技術】

軟膏基剤として従来、オクタメチルシクロテトラシロキサン等の低分子環状シリコーンとワセリンとの混合物が知られている(特開昭56-145212号)。この軟膏基剤においては、べとつきや高い粘度のため厚く塗られてしまうというワセリンの欠点は改善されているが、ワセリンの環状シリコーンへの溶解は必ずしも充分ではなく、高温時には溶解しても冷却したとき、その一部が結晶として析出し、ボソボソした使用感を与え、また時間の経過とともにこの結晶粒が増大し、使用感が悪化する欠点を有していた。

【発明が解決しようとする問題点】

本発明の目的は、上述したワセリン(油脂分)の晶出や結晶の増大を防止した、べとつきのない

優れた使用感を有するゲル状組成物を提供することにある。

【問題点を解決するための手段】

本発明の上記目的は、下記の構成を有する本発明のゲル状組成物によって達成される。

- (1) 半固型油脂分10~90% (重量パーセント、以下同じ) と低分子環状シリコーン90~10%の混合物にゲル化剤1~10%を加えてゲル化してなるゲル状組成物。
- (2) 半固型油脂分が常温で固型である油脂分と常温で液体である油脂分との混合物である第1項記載のゲル状組成物。
- (3) 環状シリコーンがオクタメチルシクロテトラシロキサンもしくはデカメチルシクロペンタシロキサンまたはそれらの混合物である第1項記載のゲル状組成物。
- (4) ゲル化剤がデキストリン脂肪酸エステル、ショ糖脂肪酸エステル、セルロース誘導体およびリン脂質の1種または2種以上よりなる第1項記載のゲル状組成物。

(例えばツバキ油、オリーブ油、ヒマシ油等)、スクアラン等があげられる。油脂分はゲル状組成物全量の10~90% (重量パーセント、以下同じ) であり、固型油脂5~45%、液状油脂5~45%が望ましい。

本発明に用いられる低分子環状シリコーンとしては、オクタメチルシクロテトラシロキサンもしくはデカメチルシクロペンタシロキサンまたはそれらの混合物 (例えば東レシリコーン社製、SH-344, SH-345) が好ましく、その配合量は全基剂量の90~10%、好ましくは50~20%である。

ゲル化剤としてはデキストリン脂肪酸エステル、ショ糖脂肪酸エステル、セルロース誘導体、リン脂質等が用いられる。デキストリン脂肪酸エステルはデキストリンの水酸基に炭素数12~18の脂肪酸がエステル結合したもので、水酸基のほとんどがエステル化されているものが用いられる。例えばレオパールKE, KL (千葉製粉社製) が好適である。ショ糖脂肪酸エステルは、ショ糖の水酸

- (5) ゲル状組成物がゲル軟膏基剤である第1項記載のゲル状組成物。

本発明は上述したように、半固型油脂分と低分子環状シリコーンとゲル化剤を含有したゲル状組成物である。

本発明で使用される半固型油脂分には特に制限はないが、常温で固型であるものと、液状であるものとの混合物が望ましい。常温で固型の油脂分の例としては、ワセリン、ラノリン、ラノリン誘導体、プラスチベース (商品名)、ワックス類 (例えばマイクロクリスクリンワックス、ビーズワックス)、固型バラフィン、硬化油、高級アルコール (例えばセタノール、ステアリルアルコール)、コレステロール、コレステロール誘導体等があげられる。常温で液体の油脂分の例としては、流動バラフィン、高級脂肪酸エステル (例えば、ミリスチン酸イソプロピル、ミリスチン酸オクチルドデシル、パルミチン酸イソプロピル等)、高級アルコール (例えばオクタノール、ヘキシルデカノール、オクチルドデカノール等)、植物油

基が炭素数4~22個の脂肪酸によりエステル化されたもので、HLBが1~2のもの (例えばDK-エステルF10, F20, 第一化学薬品社製)、または残余の水酸基がアセチル化されたもの (例えばDK-エステルFA-10E, 第一化学薬品社製) が用いられる。セルロース誘導体はエチルセルロース、エチルヒドロキシエチルセルロース等油溶性のものが好適に使用される。

リン脂質としては大豆レシチン、卵黄レシチンおよびそれらの水素添加したものを用いることができる。単一のリン脂質のみから構成される必要はなく2種以上のリン脂質を含んでいてもよくまたリン脂質以外の成分 (例えば大豆油、卵黄油) を含んでいてもよいが、その使用量はそれに含まれるリン脂質量に基づいて決定される。

ゲル化剤の使用量は概ね全組成物量の1~10%であるがその種類によても多少異なる。例えばデキストリン脂肪酸エステルの場合は2~10%、ショ糖脂肪酸エステルは1~10%、セルロース誘導体およびリン脂質は1~3%である。これらの

ゲル化剤は単独でも、また2種以上を組み合せても使用することができる。

本発明のゲル状組成物は、固型油脂分、液状油脂分およびゲル化剤の混合物を高温(好ましくは75℃以上)で搅拌し、均一な液体とし、これに同じく加熱した低分子環状シリコーンを加え、よくかきませ均一に分散させた後、かきませながら室温まで冷却することによって容易に製造される。

本発明のゲル状組成物における油脂分対低分子環状シリコーンの使用量比は、25~75%対75%~25%、好ましくは40~70%対60~30%、さらに好ましくは55~65対45~35%である。

また本発明のゲル状組成物には、外用薬として使用されている種々の薬効成分を配合させることができること

ができる。

薬効成分の例としては次のものがあげられる。

(1) 消炎剤

ハイドロコルチゾン、ブレドニゾロン等のコルチコステロイド、グリチルリチン酸、及びその塩、グリチルレチン酸及びその誘導体、サリチル酸

誘導体、アズレン等、インドメタシン、イブプロフェン等非ステロイド抗炎症剤。

(2) 消泡・殺菌剤

塩化ベンザルコニウム、塩化ベンゼトニウム、クロルヘキシジングルコネート、ポビドンヨード、ヒノキチオール、感光素、(にきび用として)ベンゾイルバーオキシド、硫黄、など(水虫用として)クロトリマゾール、トルナフテートなど。

(3) ビタミン類・ホルモン

ビタミンA、ビタミンE、アスコルビン及びその誘導体、ビタミンB₂、B₆、ニコチン酸誘導体、バントテン酸及びその誘導体、エストラジオール、など。

(4) 抗ヒスタミン薬

塩酸ジフェンヒドラミン、マレイン酸クロルフェニラミンなど。

(5) 日焼け止め

ケイ皮酸エステル類、安息香酸誘導体、ウロカニン酸、酸化チタン。

(6) 局部麻酔剤類

ベンゾカイン、リドカイン、ジブカンなど。

(7) 抗生物質

テトラサイクリン、ポリミキシンB、サンタマイシンなど。

(8) 防腐剤

バラオキシ安息香酸誘導体など。

(9) その他・香草類抽出物、アラントイン及びその誘導体、香油、メントール、カンフル、酸化亜鉛。

次に実施例を示して本発明をさらに具体的に説明する。

(以下余白)

実施例 1

	本発明	比較例
固型パラフィン	20(%)	20(%)
ワセリン	15	20
流動パラフィン	20	20
レオバールKL ¹⁾	4	-
S A 10 E ²⁾	1	-
S H 345 ³⁾	40	40
	100(%)	100(%)

上記本発明および比較例の各成分をそれぞれ透明溶液となるまで加温し、その後冷却した。

注1) 千葉製粉社製

デキストリン脂肪酸エステル

注2) 第一化学薬品社製

ショ糖脂肪酸エステル

注3) 東レシリコーン社製

低分子環状シリコーン混合物

(以下余白)

実施例 2

	本発明	比較例
固型パラフィン	20 (%)	20 (%)
ワセリン	15	15
流動パラフィン	24	25
水添リン脂質	1	—
S H 345	40	40

上記本発明および比較例の各成分をそれぞれ透明溶液となるまで加温し、その後冷却した。

実施例 3

固型パラフィン	20 (%)
プラスチベース	15
流動パラフィン	20
レオパール K L	5
S H 345	40

実施例 4

固型パラフィン	4 (%)
サラシミツロウ	3
ワセリン	3

実施例3は、汎用ゲル状組成物の例で、べとつきのない、サラッとした感触の軟膏基剤である。

実施例4は特にアトピー性皮膚炎や進行性指掌角皮症、老人性瘙痒症などの、乾燥性皮膚疾患の治療に好適なゲル状の組成物で保水性の高いアルコール系の油脂分を含有し、のびの良いサラッとした使用感を与える。

【発明の効果】

本発明によれば、使用に際してのべとつきがなく、さらに長期間保存しても油脂分の晶出や結晶の増大のない皮膚科用または化粧品用のゲル状組成物が提供される。

本発明の組成物は油脂分が低分子環状に完全に溶解しており、低い温度でも油脂分が析出することがないので常になめらかでのびがよくサラッとしたさわやかな使用感を有する。さらに本発明の組成物はゲル化剤によってゲル化されているので油脂分の溶解状態が安定であり、長期間の保存によっても油脂分が晶出したり、結晶が増大したりすることないので、なめらかな使用感が長く維持されている。

吸着製糖ラノリン	20
セタノール	3
ステアリルアルコール	1
コレステロール	3
12-ヒドロキシ	
ステアリルコレステロール	3
イソプロピルミリストート	6
オクチルドデカノール	10
レオパール K L	4
S H 344	40

上記実施例1および2のゲル状組成物はなめらかな使用感を与え、室温に60日間保存しても性状に変化は見られなかった。これに対して比較例1および2の基剤はボソボソした使用感が残り、室温60日の保存でその使用感はさらに悪化した。

偏光顕微鏡による観察で比較例1および2の組成物では固型油脂の大きな粒子($100\mu m$ 以上)が観察されたのに対し、実施例1および2の組成物では $10\mu m$ 前後の粒子が均一に分散しており、室温60日の保存でも粒径は増大しなかった。

持されている。

特許出願人 テルモ株式会社

代理人 弁理士 高木千嘉
(外2名)



Gel compsn. used as ointment base for toiletries, etc. - contains semi-solid fats and oils, low mol. cyclic silicone cpd. and gelating agent
Patent Assignee: TERUMO CORP

Patent Family

Patent Number	Kind	Date	Application Number	Kind	Date	Week	Type
JP 63216817	A	19880909	JP 8750354	A	19870306	198842	B
JP 95002631	B2	19950118	JP 8750354	A	19870306	199507	

Priority Applications (Number Kind Date): JP 8750354 A (19870306)

Patent Details

Patent	Kind	Language	Page	Main IPC	Filing Notes
JP 63216817	A		4		
JP 95002631	B2		3	A61K-009/06	Based on patent JP 63216817

Abstract:

JP 63216817 A

Gel composition which contains semi-solid fats and oils 10-90 wt.%, low molecular cyclic silicone 90-10 wt.% and gelating agent 1-10 wt.%. The semi-solid fats and oils are mixtures of fats and oils which are solid at room temp. and fats and oils which are liquid at room temp. The cyclic silicone is octamethyl-cyclotetrasiloxane or decamethyl cyclopentasiloxane or their mixture. The gelating agent is composed more than one dextrin fatty acid ester, sucrose fatty acid ester, cellulose deriv. and phospholipid. The mixture of solid fats and oils, liquid fats and oils and gelating agent, is stirred at above 75 deg.C to prepare a homogeneous liq.. To this, warmed low mol. cyclic silicone is added and stirred well to disperse homogeneously, and cooled to temp. with stirring. Ratio of the most pref. amt. of fats and oils to low mol. cyclic silicone is 55-65:45-35%. Many drugs for external use can be combined.

USE/ADVANTAGE - Used as an ointment base for dermatological and toiletry use. It is not sticky and has good use feeling. No deposition or crystallisation occurs during long period storage.

Derwent World Patents Index

© 2005 Derwent Information Ltd. All rights reserved.

Dialog® File Number 351 Accession Number 7662498